

ROYAUME DE BELGIQUE

BREVET D'INVENTION



N° BE
863.754

MINISTÈRE DES AFFAIRES ÉCONOMIQUES

Classif. Internat.: C 07 D / A 61 K

Mis en lecture le: 29-05-1978

Le Ministre des Affaires Économiques,

Vu la loi du 24 mai 1854 sur les brevets d'invention:

Vu le procès-verbal dressé le 8 février 1978 à 14 h. 35
au Service de la Propriété industrielle;

ARRÊTE :

Article 1. — Il est délivré à: Mr Pierre DESCHAMPS,
8, avenue du Pesage, Bruxelles,

repr. par le Cabinet Bede à Bruxelles,

un brevet d'invention pour: Nouveaux dérivés de la vinosaïne utilisables comme
régulateurs de la circulation cérébrale,

Article 2. — Ce brevet lui est délivré sans examen préalable, à ses risques et
périls, sans garantie soit de la réalité, de la nouveauté ou du mérite de l'invention, soit
de l'exactitude de la description, et sans préjudice du droit des tiers.

Au présent arrêté demeurera joint un des doubles de la spécification de l'invention
(mémoire descriptif et éventuellement dessins) signés par l'intéressé et déposés à l'appui
de sa demande de brevets.

Bruxelles, le 28 février 1978.

PAR DÉLÉGATION SPÉCIALE:

Le Directeur

A. SCHURMANS

853754

Monsieur Pierre DECHAMPS
à Bruxelles (Belgique)

Nouveaux dérivés de la vincamine utilisables comme régulateurs de la circulation cérébrale.

La présente invention est relative à des nouveaux dérivés de la vincamine et à leur utilisation comme agents régulateurs de la circulation cérébrale.

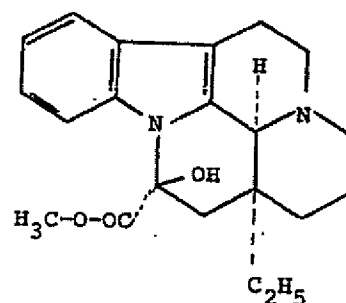
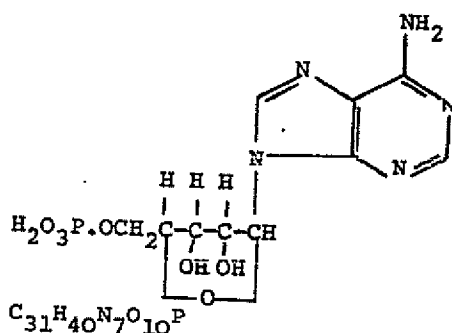
Les dérivés de vincamine, selon l'invention, sont les suivants :

- I. ADENYLATE DE VINCAMINE
- II. CODECARBOXYLATE DE VINCAMINE.

003754

I. ADENYLATE DE VINCAMINE

Poudre microcristalline blanche de saveur amère, soluble dans l'eau et le méthanol, peu soluble dans les solvants organiques.



Identification :

1. Spectre U.V.

$E_{1\text{ cm}}^{1\%}$ à 240 nm = 160
à 263 nm = 305

P.M. 701,23

2. Spectre I.R. (voir figure 1) - Pastille KBr à 3 %.

Le % de transmission se trouve en ordonnée ; la longueur d'onde en μ est donnée en abscisse, échelle supérieure et le nombre d'onde en cm^{-1} , échelle inférieure.

Procédé de fabrication :

On chauffe à reflux, sous atmosphère d'azote pendant 5 heures, 1 mole de vincamine avec 1 mole d'acide adénylique, dans 40 volumes de méthanol. On purifie par passage au noir décolorant la solution obtenue. Puis on distille sous vide pour réduire la solution au quart de son volume. Après refroidissement, on essore le précipité, on le lave avec du méthanol et on le sèche sous vide à 40°C.

85754

Propriétés physiologiques :

Vasorégulation cérébrale de la vincamine complétée par l'action cardiotonique de l'acide adénylique.

Toxicité :

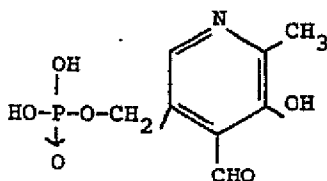
La DL 100 per os est supérieure à 1 g/kg chez la souris.

Formes galéniques :

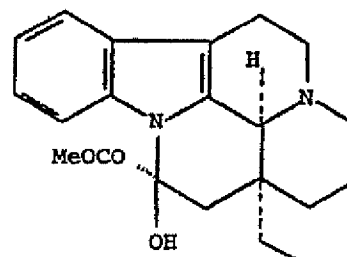
Gélules de 20 à 40 mg 2 à 3 fois par jour.

II. CODECARBOXYLATE DE VINCAMINE

Poudre microcristalline de couleur jaunâtre, soluble à froid dans les alcools, à chaud dans l'eau, très peu soluble dans l'acétone, le chloroforme, l'éther.



$C_{27}H_{36}O_9N_3$



P.M. 601,15

Identification :

1. Spectre U.V.

$E \frac{1\%}{1\text{ cm}}$ à 220 nm = 715

2. Spectre I.R. (voir figure 2) - Pastille KBr à 3 %

Procédé de fabrication :

On chauffe à reflux pendant une heure sous atmosphère d'azote et bonne agitation, une mole de vincamine et une mole d'acide 5-pyridoxal-phosphorique dans 20 volumes de méthanol à 90 %.

On filtre la solution obtenue, concentre le filtrat sous vide au bain-marie et précipite le sel par

00754

5 volumes d'éther éthylique. On essore, lave avec un volume d'éther, sèche sous vide à 25-30°C.

Propriétés physiologiques :

Vasorégulation cérébrale de la vincamine complétée par l'action anti-scléreuse de la codécarboxylase.

Toxicité :

La DL 100 per os est supérieure à 1 g/kg chez la souris.

Formes galéniques :

Gélules de 20 à 40 mg 2 à 3 fois par jour.

REVENDEICATIONS

1. Dérivé de vincamine constitué par l'adénylate de vincamine.
2. Dérivé de vincamine constitué par le codécarboxylate de vincamine.
3. Utilisation d'un dérivé de vincamine selon l'une quelconque des revendications 1 et 2 comme agent régulateur de la circulation cérébrale.
4. Utilisation suivant la revendication 3, caractérisée en ce que l'adénylate de vincamine est administré par voie orale en doses de 20 à 40 mg 2 à 3 fois par jour pour obtenir une vasorégulation cérébrale complétée par une action cardiotonique.
5. Utilisation suivant la revendication 3, caractérisée en ce que le codécarboxylate de vincamine est administré par voie orale en doses de 20 à 40 mg 2 à 3 fois par jour pour obtenir une vasorégulation cérébrale complétée d'une action anti-scléreuse.

003754

6. Composition pharmaceutique appropriée
à une utilisation telle que définie dans les revendications

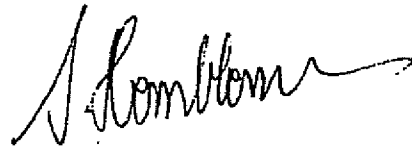
3 à 6.

7. Procédé de préparation d'un dérivé
selon l'une quelconque des revendications 1 et 2,
caractérisé en ce qu'on associe, dans des conditions de
chauffage au reflux dans un alcool et sous une atmosphère
d'azote, la vincamine avec une quantité équimoléculaire
d'un réactif porteur d'un radical adénylique ou 5-
pyridoxal-phosphorique selon le composé final voulu.

Bruxelles, le - 8 FEV. 1978

PPon. : Monsieur Pierre DECHAMPS

PPon. : CABINET BEDE, R. van Schoonbeek.



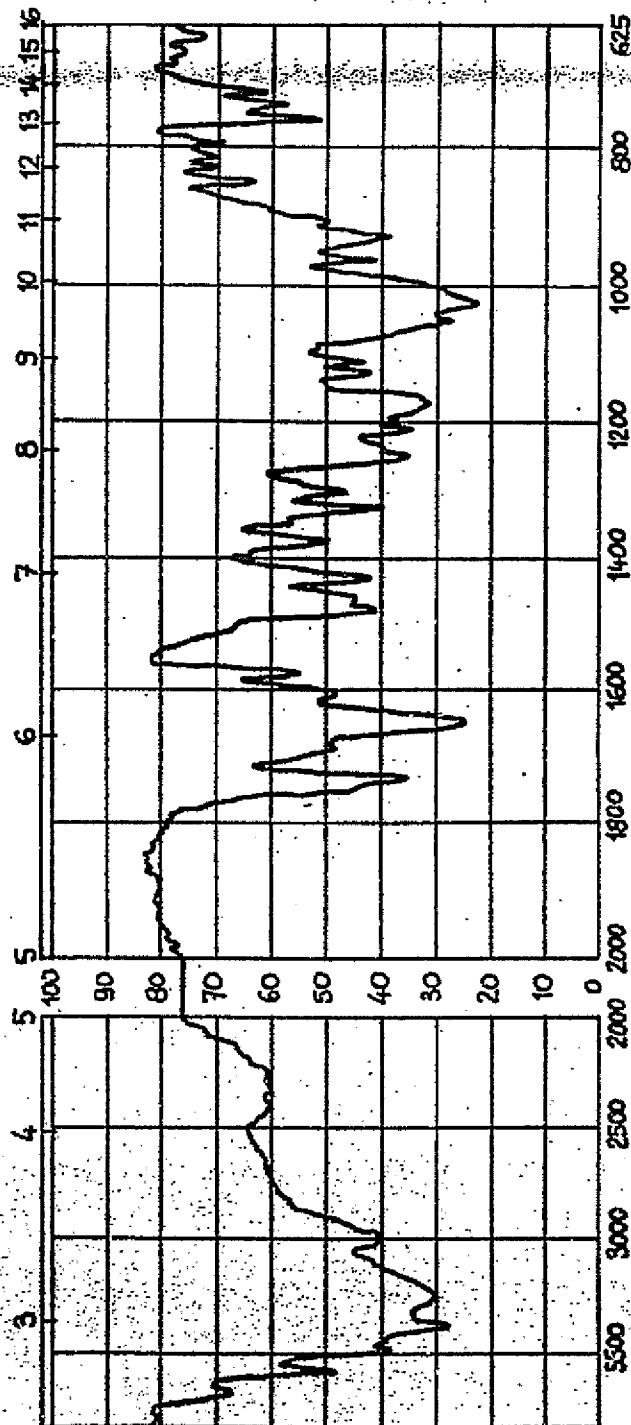


FIG. 1

Bruxelles, le 8 février 1978.
 P.PON. Monsieur Pierre DECHAMPS
 P.PON. Cabinet BEDE, R. van SCHOONBEKE

S. Demblon

Pierre DECHAMPS

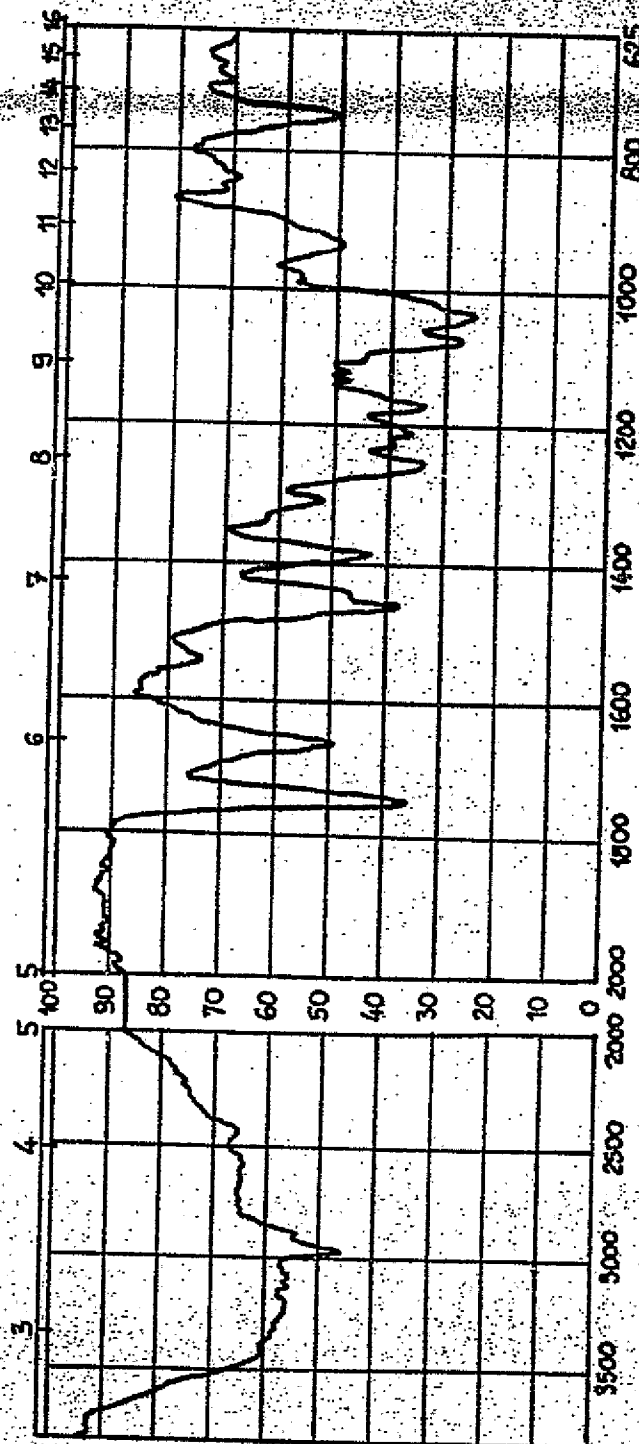


FIG. 2

Bruxelles, le 8 février 1978
P.PON. Monsieur Pierre DECHAMPS
P.PON. Cabinet BEDE, R. van SCHOONBEEK

S. Hembler